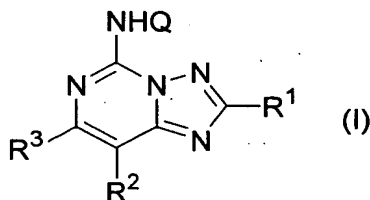


ABSTRACT

The present invention provides [1,2,4]triazolo[1,5-c]pyrimidine derivatives or pharmaceutically acceptable salts thereof which have adenosine A_{2A} receptor antagonism and are useful for treating and/or preventing a disease induced by hyperactivity of an adenosine A_{2A} receptor, the derivatives being represented by formula (I):



(wherein R¹ represents substituted or unsubstituted aryl or a substituted or unsubstituted aromatic heterocyclic group; R² represents a hydrogen atom, halogen, lower alkyl, lower alkanoyl, aroyl, substituted or unsubstituted aryl, or a substituted or unsubstituted aromatic heterocyclic group; R³ represents lower alkyl, lower cycloalkyl, substituted or unsubstituted lower alkanoyl, substituted or unsubstituted aryl, or a substituted or unsubstituted aromatic heterocyclic group; and Q represents a hydrogen atom or 3,4-dimethoxybenzyl).

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004年4月8日 (08.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/029056 A1(51) 国際特許分類: C07D 487/04, A61K 31/519,
31/5377, 31/55, 31/553, A61P 9/00, 9/10, 21/00, 25/00,
25/14, 25/16, 25/20, 25/24, 25/28, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/012158

(22) 国際出願日: 2003年9月24日 (24.09.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

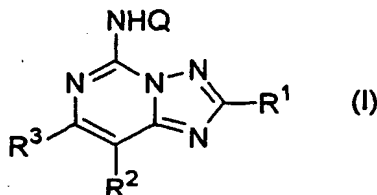
(30) 優先権データ:
特願2002-276896 2002年9月24日 (24.09.2002) JP
特願2003-139994 2003年5月19日 (19.05.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 協和
醸酵工業株式会社 (KYOWA HAKKO KOGYO CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒100-8185 東京都千代田区大手町一
丁目6番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 飯田 恭一郎
(IIDA, Kyoichiro) [JP/JP]; 〒411-8731 静岡県駿東郡長
泉町下土狩 1188 協和醸酵工業株式会社 医薬総
合研究所内 Shizuoka (JP). 杉田 隆昌 (SUGITA, Taka-
masa) [JP/JP]; 〒411-8731 静岡県駿東郡長泉町下土
狩 1188 協和醸酵工業株式会社 医薬総合研究所内
Shizuoka (JP). 塩崎 静男 (SHIOZAKI, Shizuo) [JP/JP];
〒411-8731 静岡県駿東郡長泉町下土狩 1188 協
和醸酵工業株式会社 医薬総合研究所内 Shizuoka (JP).神田 知之 (KANDA, Tomoyuki) [JP/JP]; 〒411-8731 静
岡県駿東郡長泉町下土狩 1188 協和醸酵工業株
式会社 医薬総合研究所内 Shizuoka (JP). 桑名 良寿
(KUWANA, Yoshihisa) [JP/JP]; 〒100-8185 東京都千代
田区大手町一丁目6番1号 協和醸酵工業株式会社本
社内 Tokyo (JP). 島田 純一 (SHIMADA, Junichi) [JP/JP];
〒411-8731 静岡県駿東郡長泉町下土狩 1188 協
和醸酵工業株式会社 医薬総合研究所内 Shizuoka (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR,
HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: [1,2,4]-TRIAZOLO[1,5-c]PYRIMIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: [1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン誘導体

(57) Abstract: A [1,2,4]-triazolo[1,5-c]pyrimidine derivative represented by the
general formula (I): (I) (wherein R¹ represents (un)substituted aryl or an (un)substi-
tuted aromatic heterocyclic group; R² represents hydrogen, halogeno, lower alkyl,
lower alkanoyl, aroyl, (un)substituted aryl, or an (un)substituted aromatic hete-
rocyclic group; R³ represents lower alkyl, lower cycloalkyl, (un)substituted lower
alkanoyl, (un)substituted aryl, an (un)substituted aromatic heterocyclic group, etc.;
and Q represents hydrogen or 3,4-dimethoxybenzyl) or a pharmacologically ac-
ceptable salt of the derivative. They have antagonistic activity on an adenosine
A_{2A} receptor and are useful for treatments for and/or prevention of diseases attrib-utable to adenosine A_{2A} receptor hyperenergia.

[続葉有]

WO 2004/029056 A1